

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

Absender: INTERNATIONALE RECHERCHENBEHÖRDE

PCT

An:

siehe Formular PCT/ISA/220

SCHRIFTLICHER BESCHIED DER INTERNATIONALEN RECHERCHENBEHÖRDE (Regel 43bis.1 PCT)

Absendedatum
(Tag/Monat/Jahr) siehe Formular PCT/ISA/210 (Blatt 2)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts
siehe Formular PCT/ISA/220

WEITERES VORGEHEN
siehe Punkt 2 unten

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/002407

Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)
09.03.2004

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)
03.04.2003

Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK
C07D413/12, C07D401/12, C07D453/06, C07D403/12, C07C275/26, A61K31/5377, A61K31/4155, A61K31/4748,

Anmelder
MERCK PATENT GMBH

1. Dieser Bescheid enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- ☒ Feld Nr. I Grundlage des Bescheids
- ☒ Feld Nr. II Priorität
- ☐ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- ☐ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43bis.1(a)(i) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- ☐ Feld-Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen
- ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

2. WEITERES VORGEHEN

Wird ein Antrag auf internationale vorläufige Prüfung gestellt, so gilt dieser Bescheid als schriftlicher Bescheid der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde ("IPEA"); dies trifft nicht zu, wenn der Anmelder eine andere Behörde als diese als IPEA wählt und die gewählte IPEA dem Internationalen Büro nach Regel 66.1bis b) mitgeteilt hat, daß schriftliche Bescheide dieser Internationalen Recherchenbehörde nicht anerkannt werden.

Wenn dieser Bescheid wie oben vorgesehen als schriftlicher Bescheid der IPEA gilt, so wird der Anmelder aufgefordert, bei der IPEA vor Ablauf von 3 Monaten ab dem Tag, an dem das Formblatt PCT/ISA/220 abgesandt wurde oder vor Ablauf von 22 Monaten ab dem Prioritätsdatum, je nachdem, welche Frist später abläuft, eine schriftliche Stellungnahme und, wo dies angebracht ist, Änderungen einzureichen.

Weitere Optionen siehe Formblatt PCT/ISA/220.

3. Nähere Einzelheiten siehe die Anmerkungen zu Formblatt PCT/ISA/220.

Name und Postanschrift der mit der internationalen
Recherchenbehörde



Europäisches Patentamt
D-80298 München
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d
Fax: +49 89 2399 - 4465

Bevollmächtigter Bediensteter

Cortés, J

Tel. +49 89 2399-8206



INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/002407

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 0164642 A	07-09-2001	AU 4535301 A	12-09-2001
		AU 5078301 A	12-09-2001
		AU 7486700 A	17-04-2001
		BR 0014076 A	15-10-2002
		CA 2385592 A1	22-03-2001
		CA 2401778 A1	07-09-2001
		CN 1391555 T	15-01-2003
		CZ 20020961 A3	14-08-2002
		EP 1216228 A2	26-06-2002
		EP 1259485 A2	27-11-2002
		HU 0203289 A2	28-01-2003
		JP 2003509406 T	11-03-2003
		NO 20021229 A	21-05-2002
		WO 0119788 A2	22-03-2001
		WO 0164642 A2	07-09-2001
		WO 0164643 A2	07-09-2001
		US 2003162690 A1	28-08-2003
		US 2004097561 A1	20-05-2004
		US 2002002183 A1	03-01-2002
WO 02074735 A	26-09-2002	DE 10113402 A1	26-09-2002
		CA 2441427 A1	26-09-2002
		WO 02074735 A2	26-09-2002
		EP 1385818 A2	04-02-2004
		HU 0303512 A2	28-01-2004
		US 2004097550 A1	20-05-2004
WO 03024971 A	27-03-2003	CZ 20040345 A3	16-06-2004
		EP 1427727 A1	16-06-2004
		EP 1427728 A1	16-06-2004
		EP 1427732 A1	16-06-2004
		WO 03024973 A1	27-03-2003
		WO 03024970 A1	27-03-2003
		WO 03024971 A1	27-03-2003
		US 2003105084 A1	05-06-2003
		US 2003134867 A1	17-07-2003
		US 6566357 B1	20-05-2003
		US 2004038971 A1	26-02-2004
		US 2004058944 A1	25-03-2004
		US 2004087639 A1	06-05-2004

Feld Nr. II Priorität

1. ☒ Das folgende Dokument ist noch nicht eingereicht worden:

☒ Abschrift der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist (Regel 43*bis*.1 und 66.7(a)).

☐ Übersetzung der früheren Anmeldung, deren Priorität beansprucht worden ist (Regel 43*bis*.1 und 66.7(b)).

Daher war es nicht möglich, die Gültigkeit des Prioritätsanspruchs zu prüfen. Der Bescheid wurde trotzdem in der Annahme erstellt, daß das beanspruchte Prioritätsdatum das maßgebliche Datum ist.

2. ☐ Dieser Bescheid ist ohne Berücksichtigung der beanspruchten Priorität erstellt worden, da sich der Prioritätsanspruch als ungültig erwiesen hat (Regeln 43*bis*.1 und 64.1). Für die Zwecke dieses Bescheids gilt daher das vorstehend genannte internationale Anmeldedatum als das maßgebliche Datum.

3. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Regel 43*bis*.1(a)(i) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit

Ja: Ansprüche 1-21, 24-25

Nein: Ansprüche 22-23

Erfinderische Tätigkeit

Ja: Ansprüche

Nein: Ansprüche 1-25

Gewerbliche Anwendbarkeit

Ja: Ansprüche: 1-25

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

Feld Nr. I Grundlage des Bescheids

1. Hinsichtlich der **Sprache** ist der Bescheid auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache erstellt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
 - ☐ Der Bescheid ist auf der Grundlage einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache erstellt worden, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (gemäß Regeln 12.3 und 23.1 b)).
2. Hinsichtlich der **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz**, die in der internationalen Anmeldung offenbart wurde und für die beanspruchte Erfindung erforderlich ist, ist der Bescheid auf folgender Grundlage erstellt worden:
 - a. Art des Materials
 - ☐ Sequenzprotokoll
 - ☐ Tabelle(n) zum Sequenzprotokoll
 - b. Form des Materials
 - ☐ in schriftlicher Form
 - ☐ in computerlesbarer Form
 - c. Zeitpunkt der Einreichung
 - ☐ in der eingereichten internationalen Anmeldung enthalten
 - ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht
 - ☐ bei der Behörde nachträglich für die Zwecke der Recherche eingereicht
3. ☐ Wurden mehr als eine Version oder Kopie eines Sequenzprotokolls und/oder einer dazugehörigen Tabelle eingereicht, so sind zusätzlich die erforderlichen Erklärungen, daß die Information in den nachgereichten oder zusätzlichen Kopien mit der Information in der Anmeldung in der eingereichten Fassung übereinstimmt bzw. nicht über sie hinausgeht, vorgelegt worden.
4. Zusätzliche Bemerkungen:

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Stand der Technik

- D1: WO 01/64642 A (COR THERAPUTICS INC (US)) 7. September 2001 (2001-09-07)
- D2: WO 02/074735 A (MERCK PATENT GMBH (DE)) 26. September 2002 (2002-09-26)
- D3: DATABASE MEDLINE [Online] US NATIONAL LIBRARY OF MEDICINE (NLM), BETHESDA, MD, US; 1972, ROUBAL Z ET AL: "Newly synthesized pyrazolidine derivatives as potential activators of fibrinolysis and antiaggregating agents." XP002283716 Database accession no. NLM4669826
- D4: DATABASE MEDLINE [Online] US NATIONAL LIBRARY OF MEDICINE (NLM), BETHESDA, MD, US; 1972, MURATOVÁ J ET AL: "Effect of pyrazolidine derivatives on experimental venous thrombosis in rabbits." XP002283717 Database accession no. NLM4273931
- D5: DATABASE CHEMABS [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1994, VAINIOTALO, P. ET AL: "N,N-Coupled heterobicycles from cyclic hydrazine derivatives. Part 6. Electron ionization mass spectrometry of some substituted 1-thiocarbamoyl and 1-carbamoylpyrazolidines" XP002283718 gefunden im STN Database accession no. 1994:190889
- D6: DATABASE CHEMABS [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1973, ZINNER, G. ET AL: "Carbamoylation of hydrazine derivatives" XP002283719 gefunden im STN Database accession no. 1973:97543
- D7: DATABASE CHEMABS [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1972, BOLLBUCK, GUENTER ET AL: "Reactions of 4-aryl semicarbazides" XP002283720 gefunden im STN Database accession no. 1972:59168

D8: WO 03/024971 A (PROCTER & GAMBLE) 27. März 2003 (2003-03-27)

Neuheit (Artikel 33(2) PCT)

D5-D7 offenbaren Verbindungen, die unter die vorliegenden Ansprüche 22 und 23 fallen. Diese Ansprüche sind daher nicht neu.

Der vorliegende Anspruch 1 ist eine neue Auswahl aus D1. Das Unterscheidungsmerkmal ist dabei der spezifisch ausgewählte Pyrazolidinring als mittlerer Heterocyclus.

Die vorliegenden Verbindungen unterscheiden sich von den Verbindungen in D2 im Pyrazolidinring und von den Verbindungen in D3 und D4 in den Substituenten des Pyrazolidinrings.

Die Zwischenverbindungen der Ansprüche 19-21 sind im Stand der Technik nicht beschrieben.

Die Zwischenverbindungen der Ansprüche 22-23 unterscheiden sich von der in D8 offenbarten Zwischenverbindung im Substituenten R1.

Erfinderische Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT)

D1 und D2 offenbaren Inhibitoren des Koagulationsfaktors Xa, D3 und D4 offenbaren koagulationshemmende Pyrazolinderivate. D1 kann als nächster Stand der Technik angesehen werden.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war die Bereitstellung von neuen Inhibitoren des Koagulationsfaktors Xa.

Die vorliegenden Verbindungsgruppe ist eine Auswahl aus D1. Ihre pharmakologische Wirkung ist ebenfalls in D1 offenbart. Eine erfinderische Tätigkeit ist daher nicht gegeben.

**SCHRIFTLICHER BESCHEID
DER INTERNATIONALEN
RECHERCHEBEHÖRDE (BEIBLATT)**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/002407

Sonstige Anmerkungen

Es wurden zwei Ansprüche mit der Nummer 23 numeriert.